### (19) Weltorganisation für geistiges Eigentum Internationales Büro



## ) – I CERTE ENGRED IN ETENE FIEL EETEN EELEN EIN EN EN EELEN WIN EELEN EINE EN ELEN EELEN EELEN EELEN EELEN EEL

## (43) Internationales Veröffentlichungsdatum 7. April 2005 (07.04.2005)

### **PCT**

# (10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO 2005/03033 A3

- (51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61P 25/28, 25/14, 25/16, 3/10, 25/08, 9/10, 25/00, A61K 31/55, C07D 491/10
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/AT2004/000309
- (22) Internationales Anmeldedatum:

9. September 2004 (09.09.2004)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

A 1538/2003 29. September 2003 (29.09.2003) AT A 1174/2004 12. Juli 2004 (12.07.2004) AT

- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): SANOCHEMIA PHARMAZEUTIKA AG [AT/AT]; Boltzmanngasse 11, A-1090 Wien (AT).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): CZOLLNER, Laszlo [AT/AT]; Wiener Neustädter Strasse 28, A-2490 Ebenfurth

(AT). KÄLZ, Beate [AT/AT]; Gartengasse 21/5/1, A-7035 Steinbrunn (AT). WELZIG, Stefan [AT/AT]; Boerhaavegasse 8a/2/617, A-1030 Wien (AT). FRANTSITS, Werner, J. [AT/AT]; Nothartgasse 19, A-1130 Wien (AT). JORDIS, Ulrich [AT/AT]; Hasenauerstrasse 61, A-1180 Wien (AT). FRÖHLICH, Johannes [AT/AT]; Raitlstrasse 93, A-2392 Dornbach/Wienerwald (AT).

- (74) Anwälte: BEER, Manfred usw.; Lindengasse 8, A-1070 Wien (AT).
- (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: NOVEL DERIVATIVES OF 4A,5,9,10,11,12-HEXAHYDROBENZOFURO[3A,3,2] [2]- BENZAZEPINE, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF AND USE THEREOF IN THE PRODUCTION OF MEDICAMENTS

(54) Bezeichnung: NEUE DERIVATE DES 4A,5,9,10,11,12-HEXAHYDROBENZOFURO[3A,3,2] [2]- BENZAZEPIN, VERFAHREN ZU DEREN HERSTELLUNG SOWIE DEREN VERWENDUNG ZUR HERSTELLUNG VON ARZNEIMITTELN

$$H_{3}C^{-0}$$
 $J_{12a}$ 
 $J_{12a}$ 
 $J_{11}$ 
 $J_{12a}$ 
 $J_{12a}$ 
 $J_{11}$ 
 $J_{12a}$ 
 $J_{12a}$ 
 $J_{11}$ 
 $J_{12a}$ 
 $J_{12a$ 

- (57) Abstract: The invention relates to novel derivatives of 4a,5,9,10,11,12-hexahydro-benzofuro[3a,3,2] [2]benzazepine of general formulae 1a, 1b and 1c. Compounds 1a, 1b and 1c can be produced in an efficient manner on an industrial scale with the desired optical purity and are suitable for the production of medicaments for the treatment of a diverse range of symptoms, particularly diseases of the central nervous system (CNS), on account of the pharmacological effect thereof.
- (57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft neue Derivate des 4a,5,9,10,11,12-Hexahydro-benzofuro[3a,3,2] [2]benzazepin mit den allgemeinen Formeln 1a, 1b und 1c. Die Verbindungen 1a, 1b und 1c lassen sich nicht nur in effizienter Weise mit der gewünschten optischen Reinheit im Industriemassstab herstellen sondern sie eignen sich aufgrund

ihrer pharmakologischen Wirkung auch für die Herstellung von Arzneimitteln für die Behandlung verschiedenster Krankheitsbilder, insbesondere von Erkrankungen des zentralen Nervensystems (ZNS).



### WO 2005/030333 A3



GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

#### (88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 23. Juni 2005

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.